

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 9 月 15 日 (15.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/085214 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 249/06, A61K 31/4192, 31/427, 31/436, 31/437, 31/4375, 31/4439, 31/4709, 31/4725, 31/496, 31/498, 31/517, 31/5377, A61P 1/06, 9/10, 25/04, 25/16, 25/18, 25/22, 25/28, 25/30, 29/00, C07D 401/04, 401/14, 403/04, 405/04, 405/14, 417/04, 417/14, 471/04, 491/052

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/004379

(22) 国際出願日: 2005 年 3 月 7 日 (07.03.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-063243 2004 年 3 月 5 日 (05.03.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYUPHARMACEUTICAL CO., LTD) [JP/JP]; 〒1038416 東京都中央区日本橋本町 2 丁目 2 番 3 号 Tokyo (JP).

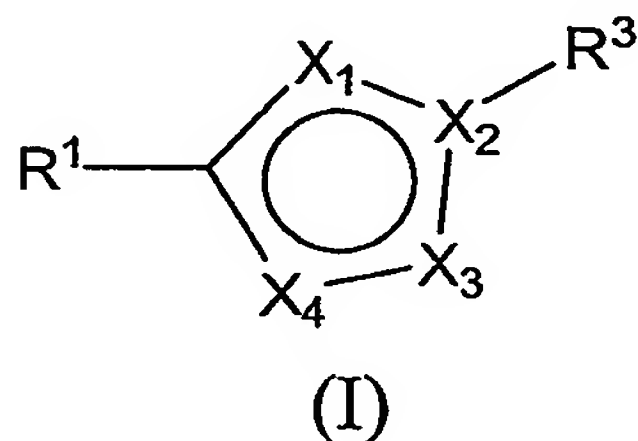
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 川元 博 (KAWAMOTO, Hiroshi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所内 Ibaraki (JP). 伊藤 智 (ITO, Satoru) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 佐藤 淳志 (SATO, Atsushi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 永富 康司 (NAGATOMI, Yasushi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 平田 ゆかり (HIRATA, Yukari) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番地 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 木村 敏史 (KIMURA, Toshifumi) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 鈴木 元太郎 (SUZUKI, Gentaroh) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 佐藤 啓生 (SATO, Akio) [JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保 3 番 萬有製薬株式会社つくば研究所 Ibaraki (JP). 太田 尚 (OHTA, Hisashi)

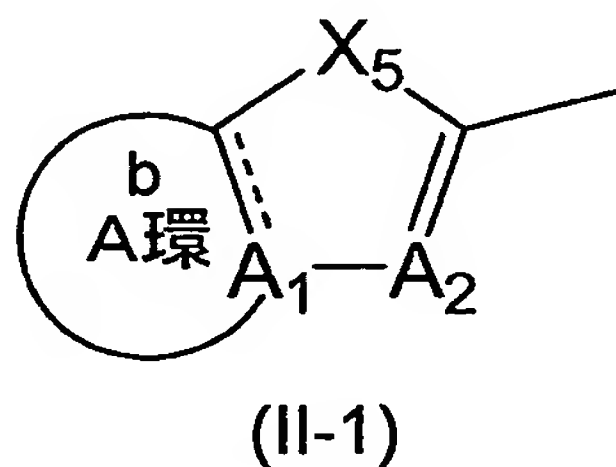
[続葉有]

(54) Title: DIARYL-SUBSTITUTED FIVE-MEMBERED HETEROCYCLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: ジアリール置換複素 5 員環誘導体



(57) Abstract: A compound represented by the formula (I): [wherein X₁ represents oxygen, etc.; X₂ represents nitrogen, etc.; X₃ represents nitrogen, etc.; X₄ represents nitrogen, etc.; and R¹ represents the formula (II-1): (A) ring A (wherein X₅ represents sulfur, etc.; A₁ represents carbon, etc.; A₂ represents nitrogen, etc.; and ring A represents phenyl, etc.)] or a pharmaceutically acceptable salt of the compound. They have mGluR1 inhibitory activity and are useful in the prevention or treatment of convulsion, acute pains, inflammatory pains, chronic pains, brain disorders such as brain infarction or transient cerebral ischemic attack, mental function disorders such as schizophrenia, anxiety, drug dependence, Parkinson's disease, or gastrointestinal disorders.



b...A RING

[続葉有]



[JP/JP]; 〒3002611 茨城県つくば市大久保3番 萬有製薬株式会社 つくば研究所 Ibaraki (JP).

(74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO.,LTD); 〒1038416 東京都中央区日本橋本町2丁目2番3号 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

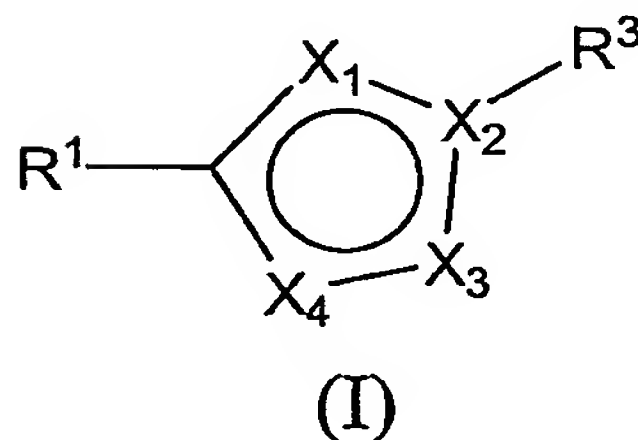
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

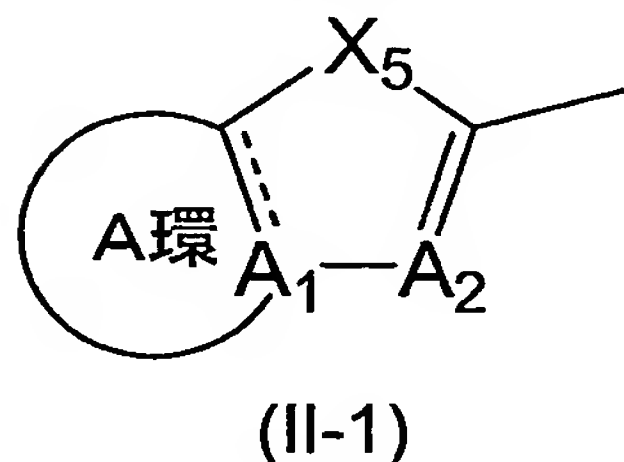
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は、mGluR1阻害作用を有し、痙攣、急性疼痛、炎症性疼痛、慢性疼痛、脳梗塞又は一過性脳虚血発作の脳障害、統合失調症等の精神機能障害、不安、薬物依存及、パーキンソン病又は胃腸障害の予防又は治療に有用である式 (I)



[式中、X₁は酸素原子等を示し、X₂は窒素原子等を示し、X₃は窒素原子等を示し、X₄は窒素原子等を示し、R¹は式 (II-1)



(式中、X₅は硫黄原子等を示し、A₁は炭素原子等を示し、A₂は窒素原子等を示し、A環はフェニル基等示す)] で表される化合物又はその薬学的に許容される塩を提供する。